



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 201534330 A

(43) 公開日：中華民國 104 (2015) 年 09 月 16 日

(21) 申請案號：103137725

(22) 申請日：中華民國 103 (2014) 年 10 月 31 日

(51) Int. Cl. :

*A61K8/21 (2006.01)**A61K8/73 (2006.01)**A61Q11/00 (2006.01)*

(30) 優先權：2013/11/19

世界智慧財產權組織

PCT/US13/70679

(71) 申請人：美國棕欖公司 (美國) COLGATE-PALMOLIVE COMPANY (US)

美國

(72) 發明人：喬伊亞克 馬里路 JOZIAK, MARILOU (US)；布蘭凡利特 克勞迪 BLANVALET, CLAUDE (BE)；摩根 艾黛兒密雪兒 MORGAN, ANDRE MICHELLE (US)；比恩 邁克爾 PRENCIPE, MICHAEL (US)

(74) 代理人：林秋琴；陳彥希

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 16 頁

(54) 名稱

改良的牙齒塗漆組成物及其使用方法

IMPROVED TOOTH VARNISH COMPOSITIONS AND METHODS FOR THEIR USE

(57) 摘要

本揭示文係提供包括，除其他外，乙基纖維素和氟化物之敏感預防性牙齒塗漆組成物，以及使用此等組成物供治療敏感性牙齒之方法。

The disclosure provides hypersensitivity preventative tooth varnish compositions comprising, inter alia, ethyl cellulose and fluoride, and methods for the use of such compositions for the treatment of hypersensitive teeth.

201534330

發明摘要

※ 申請案號：103137725

※ 申請日：103. 10. 31

※IPC 分類：A61K 8/21 (2006.01)
A61K 8/73 (2006.01)
A61Q 11/00 (2006.01)

【發明名稱】(中文/英文)

改良的牙齒塗漆組成物及其使用方法

IMPROVED TOOTH VARNISH COMPOSITIONS AND METHODS
FOR THEIR USE

【中文】

本揭示文係提供包括，除其他外，乙基纖維素和氟化物之敏感預防性牙齒塗漆組成物，以及使用此等組成物供治療敏感性牙齒之方法。

【英文】

The disclosure provides hypersensitivity preventative tooth varnish compositions comprising, *inter alia*, ethyl cellulose and fluoride, and methods for the use of such compositions for the treatment of hypersensitive teeth.

【代表圖】

【本案指定代表圖】：無。

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

無

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

改良的牙齒塗漆組成物及其使用方法

IMPROVED TOOTH VARNISH COMPOSITIONS AND METHODS
FOR THEIR USE

【技術領域】

【0000】 本揭示文係提供包括，除其他外，乙基纖維素和氟化物之敏感預防性牙齒塗漆組成物，以及使用此等組成物供治療敏感性牙齒之方法。

【先前技術】

【0001】 氟化物組成物通常係藉由許多方法和組成物施用於牙齒，最常見的係利用含氟化物的潔牙劑組成物，例如牙膏和漱口水。

【0002】 然而，有其中希望氟化物組成物與牙齒長期接觸，以及氟化物的用量超過存在於潔牙劑組成物中氟化物的量之特定情況。

【0003】 例如，可能希望長時間以高量的氟化物治療口乾症(嘴巴乾燥)、牙齒過敏、牙齒齲蝕。

【0004】 因此，已開發出牙齒塗漆組成物，其係直接塗覆在牙齒表面，例如藉由噴霧或使用牙刷。在組成物被機械性用具，例如牙刷和咀嚼食物磨損之前，因溶劑從牙齒表面蒸發所形成的膜而得以暴露較長的時間(例如約或大於 2 小時)。

【0005】 一牙齒塗漆，及在含有天然成膜成份，例如蟲膠和蟲膠蠟之特別的牙齒塗漆中的缺點，為在某些情況下其可能具有逐批達不到完全均勻的傾向，因而影響流變性質，例如黏度，其可能造成氟化物(或其他活性成份)塗覆不均，或增加組成物塗覆於牙齒表面的困難性。

【0006】 因此，對於含有適當的合成物質供包含在牙齒塗漆中以提供良好製造、塗覆和效能性，特別是在非水性牙齒塗漆組成物中之改良的牙齒塗漆組成物有此需求。

【發明內容】

【0007】 除非另有指出，否則術語「%」或「百分比」當與本發明牙齒塗漆組成物之成份聯用時，希望係指牙齒塗漆組成物中所指成份之濕重的百分比。

【0008】 在某些實施例中，本發明係提供一非水性敏感預防性牙齒塗漆組成物，其係包括：一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；乳香脂；及一非水性溶劑；其中 i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及 ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。

【0009】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物進一步係包括松香。

【0010】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物進一步係包括蜂蠟。

【0011】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物係包括一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；選自乳香脂、松香及其組合物之植物樹脂；及一非水性溶劑；其中 i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及 ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。在此實施例之此方面的一實施例中，此塗漆進一步係包括蜂蠟。

【0012】 在某些實施例中，乙基纖維素，以組成物的重量計，係以至高5%之量存在，較佳地從1%至5%，或從1%至4%，更佳地從2%至3%，例如2.5%。

【0013】 在本發明牙齒塗漆組成物之另外的實施例中，此氟化物來源為氟化鈉，其以組成物的重量計，係以4%至10%，或5%，或6%，或7%，或8%，或9%之量存在。一般而言，氟化物來源之量係等於或大於牙齒塗漆組成物中乙基纖維素之量。

【0014】 在本發明牙齒塗漆組成物之某些實施例中，松香係視需要以 25%至 40%，或 30%至 35%，或 31%，32%，33%或 34%之量存在於牙齒塗漆組成物；乳香脂：1)當松香亦以 25%至 35%，或 27%至 32%，或 28%至 31%，或 29%或 30%之量存在時，及 2)當松香不存在時，係以 50%至 70%，或 55%至 65%，或 58%至 62%，或 60%，61%或 62%之量存在於牙齒塗漆組成物中；及蜂蠟，以組成物的重量計，係以 1%至 5%，或 2%，或 3%，或 4%或 5%之量存在於牙齒塗漆組成物中。

【0015】 在本發明牙齒塗漆組成物之某些實施例中，此蜂蠟為白色蜂蠟。

【0016】 在本發明牙齒塗漆組成物之某些實施例中，此乙基纖維素為 N100PH。

【0017】 在本發明牙齒塗漆組成物之某些實施例中，此非水性溶劑為 96%乙醇，其以組成物的重量計，係以 20%至 40%，或 25%至 35%，或 25%至 30%，或 25%，26%，27%，28%，29%或 30%之量存在。

【0018】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物係包括：以組成物的重量計，4%至 6%之量的氟化鈉；1%至 5%，或 2%至 3%之量的乙基纖維素，較佳地 N100PH；30%至 35%之量的松香；28%至 30%之量的乳香脂；2%至 4%之量的蜂蠟，較佳地白色蜂蠟；以及 25%至 30%之量的 96%乙醇溶劑。

【0019】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物進一步係包括一或多種甜味劑，及/或一或多種調味劑。

【0020】 本發明亦提供預防牙齒敏感之方法，以及用於人類或家畜中治療牙齒敏感症狀之方法，其係包括將本發明之牙齒塗漆組成物塗覆於動物之牙齒或牙齦組織。在某些實施例中，係以刷子或噴霧來塗覆。

詳細說明

【0021】 依照本發明已發現，乙基纖維素可以相當低的濃度運用於含松香/乳香脂為基底的成膜組份之牙齒塗漆組成物中，用以有效地將含氟化物的活性物(例如氟化鈉)懸浮於組成物中。使用合成的乙基纖維素替代天然

生成的牙齒塗漆懸浮組份(例如蟲膠和蟲膠蠟)，就增加塗漆組成物的稠度而言具有顯著的利益。

【0022】 因此，在一實施例中，本發明係提供非水性敏感預防性牙齒塗漆組成物，其係包括：一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；乳香脂；蜂蠟；及一非水性溶劑；其中 i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及 ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。

【0023】 乙基纖維素係以有效達到懸浮氟化物來源之量用於本發明組成物中。亦即，有效提供一均勻懸浮含氟化物粒子之量，而無明顯的分離及/或沉澱。

【0024】 乙基纖維素為纖維素之乙醚衍生物。纖維素為長鏈的 β 無水葡萄糖單元藉由縮醛鍵聯共同連結所組成的天然多糖。各無水葡萄糖單元具有三個羥基，其可形成乙基醚，例如藉由乙基氯與鹼纖維素反應，因而得到乙基纖維素。在不同的乙基纖維素產品中，乙氧化的程度各不相同。無水葡萄糖單元上全部三個基團的完全取代能得到具有取代值3或54.88%乙氧基之三乙基醚。然而，完全經取代的三乙基纖維素缺乏強度和柔韌性，為非熱塑性，且顯現極有限的相容性和溶解性。取代的程度，以及分子量，影響產品的黏度和溶解度。在特定的實施例中，此乙基纖維素，具有每個無水葡萄糖單元介於2.25至2.60個乙氧基基團之平均取代值，或44-52%乙氧基含量。在特定的實施例中，此乙基纖維素，具有每個無水葡萄糖單元2.46-2.58個乙氧基基團之平均取代值，相當於48-49.5%之乙氧基含量。

【0025】 較佳地，此乙基纖維素係具有50-200 cps之黏度，較佳地80-120 cps，更佳地90-110 cps或80-105 cps，例如約100 cps，例如其中黏度係使用5%乙基纖維素溶於80份甲苯：20份乙醇中在25°C所測量。

【0026】 可用於本發明中較佳的乙基纖維素之實例包括Aqualon® N100乙基纖維素(Hercules Corp.)和Ethocel® Standard 100 (Dow Chem. Co.)。一特佳的乙基纖維素為N100PH。

【0027】 乙基纖維素係以相當低的濃度用於本發明組成物中，例如，以組成物的重量計，至高5%，較佳地1%至5%，或1%至4%，更佳地2%至

3%，例如2.5%。與許多其他含乙基纖維素之組成物相反，本發明組成物中乙基纖維素的濃度係低於或等於含氟化物活性劑(例如氟化鈉)之濃度。

【0028】 調配物亦含有天然的樹脂和蠟。例如，調配物係包括(i)乳香脂，一種得自乳香樹(乳香黃連木(*Pistacia lentiscus*))之樹脂；(ii)蜂蠟，例如白色蜂蠟，一種由蜜蜂(*Apis spp.*)所製造的天然蠟，主要包括脂肪酸的酯類和各種長鏈的醇類；及(在某些實施例中)(iii)松香，一種由各種植物，例如特定的松樹和針葉樹種之殘株或樹液所衍生的半透明黃色至棕色樹脂。

【0029】 不希望受限於任何理論，咸信在所用的濃度下，本發明組成物中的乙基纖維素，除了其他外，係用作為含氟化物活性成份之懸浮劑。令人驚訝的，這些相當低濃度的乙基纖維物賦予必要的增加黏度性質，足以使其用作為本發明組成物中之懸浮劑。

【0030】 本發明之牙齒塗漆組成物含有一氟化物來源—亦即，對口腔護理和衛生具有有利效應之含氟化合物，例如減少琺瑯質在酸中溶解及保護牙齒對抗蛀蝕。典型的氟化物來源包括氟化物離子之可溶性鹽類；例如，氟化鈉、氟化鉀、氟化鈣、氟化鋅、氟化鋅銨、氟化鋰、氟化銨、氟化亞錫、氟銨酸亞錫及錯合的氟化物、單氟磷酸鹽及其鹽類例如，如單氟磷酸鈉或單氟磷酸鉀、月桂胺氫氟酸鹽、二乙基胺基乙基辛醯基醯胺氫氟酸鹽、二癸基二甲基氟化銨、十六烷基氟化吡錠、二月桂基氟化嗎福啉鎊、肌胺酸氟化亞錫、甘胺酸氟化鉀、甘胺酸氫氟酸鹽及氟化胺。氟化物離子來源可以鹽或黏性(slime)製備物存在。較佳地，氟化物離子來源係為鹽之形式。一特佳的氟化物離子來源為氟化鈉。

【0031】 氟化物離子來源最佳地係以能在化合物中提供高量的氟化物離子之量存在，其為至少約5,000 ppm，及在某些情況下至高多如50,000 ppm，例如約7,000 ppm至約40,000 ppm，約15,000 ppm至約30,000 ppm，或約22,000或23,000 ppm。為了提供此等最佳ppm範圍內的濃度，依照不同氟化物離子來源之化學計量性質，組成物中氟化物離子來源之確切的重量百分比可不同。然而，在較佳的實施例中，此氟化物離子來源為氟化鈉，其以組成物的重量計，係以4%至10%，或5%，或6%，或7%，或8%，或9%

之量存在組成物中。一般而言，氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量之存在。

【0032】 本發明組成物希望係藉由刷子或噴霧來塗覆至牙齒表面，亦即，一口腔內的表面，例如齒頰和牙舌表面，並在溶劑蒸發時形成一薄膜。所生成的薄膜，其係在原位形成，使得懸浮的活性氟化物來源保持與牙齒表面接觸一段時間，典型地直到此薄膜被物理性手段，例如刷洗或咀嚼食物移除。因此，本發明組成物係含有一成膜組份，其包括乳香脂和蜂蠟，較佳地白色蜂蠟，及視需要松香(亦稱為樹脂(rosin))。較佳地，乳香脂：1)當松香亦以25%至35%，或27%至32%，或28%至31%，或29%或30%之量存在時，及2)當松香不存在時，係以50%至70%，或55%至65%，或58%至62%，或60%，61%或62%之量存在牙齒塗漆組成物中；及蜂蠟，以組成物的重量計，係以1%至5%，或2%，或3%，或4%或5%之量存在牙齒塗漆組成物中。乳香脂和松香二者已為本項技術所熟知，並可廣泛取得。

【0033】 本發明組成物含有一或多種非水性溶劑。較佳地，此溶劑(或溶劑之組合物)為無毒的，且當本發明組成物塗覆於牙齒時快速蒸發。適合的溶劑包括甲醇、乙醇、乙酸乙酯、丙酮和異丙醇。如上所提，本發明組成物為非水性，亦即，其不含有添加水。較佳地，本發明組成物實質上為無水的，例如含有0%重量比的水，或低於1%重量比的水。然而，如文中所用，術語非水性希望係包括可能存在本發明特定組份中之微量水，例如經由其製造過程，以及特別是包括存在96%乙醇中之水份，其為本發明組成物之較佳的溶劑，且其以組成物的重量計，較佳地係以20%至40%，或25%至35%，或25%至30%，或25%、26%、27%、28%、29%或30%之量存在。

【0034】 本發明組成物較佳地係具有大於3000厘泊(cps)，較佳地介於4000 cps至14,000 cps，例如約5000，6000，7000，8000，9000，10,000，11,000，12,000，13,000或14,000 cps之黏度。

【0035】 此外，組成物亦為觸變性的，且因此在塗覆期間更容易展開。此等相當高的黏性及觸變特性係降低及/或防止組成物在塗覆牙齒表面時跑移或滴落之傾向。

【0036】 在上述的某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物可進一步包括一或多種甜味劑、調味劑和調色劑。任何適合的調味或甜味物質皆可使用。適合的調味組成份包括調味油，例如綠薄荷油、椒薄荷油、冬青油、丁香油、鼠尾草油、尤加利油、馬鬱蘭油、肉桂油、檸檬油、萊姆油、覆盆子油和柳橙油，以及水楊酸甲酯。適合的甜味劑包括蔗糖、乳糖、麥芽糖、木糖醇、環己胺基磺酸鈉、紫蘇糖(perillartine)、AMP(天門冬醯胺基苯丙胺酸甲酯)、糖精及其類似物。適合地，風味和甜味劑，以組成物的重量計，可各別或共同包括至高 5%，或至高 4%，或至高 3%，或至高 2%，或至高 1%，或 0.5%至 1%。

【0037】 對熟習本項技術者為顯而易見的，某些本發明之組份可作為多種功用，且當化合物之身份在文中具有一種功能時，並不意味排除其在特定組成物中作其他功能之用途。

【0038】 亦請了解，組成物中的化合物彼此可能自然反應、解離及/或形成複合物。因此，特定的成份可能在原位形成，並可能在調配物中以不同的形式存在(例如，就氟化鈉溶解而言，其可為自然解離成個別的鈉和氟離子，與固體鹽相反)。如本項技術中常見的，本發明組成物係就示例性調配物成份來描述，並不希望排除產生相同最終組成物之其他成份的組合物，或排除所述成份之組合物的自然反應產物。

【0039】 各種其他物質可併入本發明之口腔製備物中，例如增白劑，包括尿素過氧化物、過氧化鈣、二氧化鈦、過氧化物氫、聚乙烯吡咯酮(PVP)之複合物和過氧化氫、防腐劑、維生素例如維生素 B6、B12、E 和 K，矽氧樹脂(silicone)、葉綠素化合物、用於處理牙齒敏感之鉀鹽，例如硝酸鉀以及抗酒石劑，例如焦磷酸二鈉和四鈉，以及鈣基底的鹽類例如磷酸二鈣、磷酸三鈣、沉澱碳酸鈣單獨或與胺基酸例如 L-精胺酸組合。這些試劑，當存在時，係以實質上對於所欲的性質和特徵不會有不利影響之量，併入本發明組成物中。

【0040】 一般而言，各前述的佐劑典型地可以至高5%之量併入本發明牙齒塗漆中，其限制條件為不能對本發明組成物之所欲的性質有不利的影響。

【0041】 本發明亦提供於人類或家畜中防止牙齒敏感之方法，以及治療牙齒敏感症狀之方法，其係包括將本發明之牙齒塗漆組成物塗覆於人類或家畜之牙齒或牙齦組織。在某些實施例中，係以刷子或以噴霧來塗覆。

【0042】 如文中所用，術語「家畜」包括一般所理解的寵物，例如狗和貓。

【0043】 在一實施例中，本發明因此係提供一敏感預防性牙齒塗漆組成物，其包括：一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；乳香脂；選自乳香脂、松香及其組合物之植物樹脂；蜂蠟；及一非水性溶劑；其中i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟(組成物1)，例如

- 1.1. 組成物1，其中該植物樹脂係包括乳香脂和松香之組合物。
- 1.2. 任何前述之組成物，其中該乙基纖維素，以組成物的重量計，係以至高5%之量存在，較佳地1%至5%，或1%至4%，更佳地2%至3%，例如2.5%。
- 1.3. 任何前述之組成物，其中該氟化物來源為氟化鈉，其以組成物的重量計，係以4%至10%，或5%，或6%，或7%，或8%，或9%之量存在。
- 1.4. 任何前述之組成物，其中該植物樹脂，以組成物的重量計，係以50%至75%，例如60-70%之量存在。
- 1.5. 任何前述之組成物，其中該蜂蠟係以1%至5%重量比之量存在。
- 1.6. 任何前述之組成物，其中(a)松香係視需要以25%至40%，或30%至35%，或31%，32%，33%或34%之量存在於牙齒塗漆組成物中；(b)乳香脂：1)當松香亦以25%至35%，或27%至32%，或28%至31%，或29%或30%之量存在時，及2)當松香不存在時，以組成物的重量計，係以50%至70%，或55%至65%，或58%至62%，或60%，61%或62%之量存在於牙齒塗漆組成物中；及(c)蜂蠟，以組成物的重量計，係以1%至5%，或2%，或3%，或4%或5%之量係存在於牙齒塗漆組成物中；
- 1.7. 任何前述之組成物，其中該蜂蠟為白色蜂蠟。
- 1.8. 任何前述之組成物，其中該乙基纖維素，具有每個無水葡萄糖單元介於2.25至2.60個乙氧基基團之平均取代值，例如44-52%乙氧基含量。

- 1.9. 任何前述之組成物，其中該乙基纖維素，具有每個無水葡萄糖單元2.46-2.58個乙氧基基團之平均取代值，例如48-49.5%之乙氧基含量。
- 1.10. 任何前述之組成物，其中該乙基纖維素係具有50-200 cps之黏度，例如80-120 cps，例如90-110 cps或80-105 cps，例如約100 cps，例如其中黏度係在約25°C使用5%乙基纖維素溶於80份甲苯：20份乙醇所組成的溶劑中之溶液所測量。
- 1.11. 任何前述之組成物，其中該乙基纖維素為Aqualon®N100乙基纖維素；Ethocel® Standard 100；或N100PH。
- 1.12. 任何前述之組成物，其中該非水性溶劑為96%乙醇，其以組成物的重量計，係以20%至40%，或25%至35%，或25%至30%，或25%，26%，27%，28%，29%或30%之量存在。
- 1.13. 任何前述之組成物，係包括：以組成物的重量計，4%至6%之量的氟化鈉；以組成物的重量計，2%至3%之量的乙基纖維素；以組成物的重量計，30%至35%之量的松香；以組成物的重量計，28%至30%之量的乳香脂；以組成物的重量計，2%至4%之量的蜂蠟，較佳地白色蜂蠟；以及以組成物的重量計，25%至30%之量的96%乙醇溶劑。
- 1.14. 任何前述之組成物，係包括：以組成物的重量計，5%之量的氟化鈉；以組成物的重量計，2.5%之量的乙基纖維素；以組成物的重量計，32%至33%之量的松香；以組成物的重量計，29%至30%之量的乳香脂；以組成物的重量計，3%之量的蜂蠟，較佳地白色蜂蠟；以及以組成物的重量計，27%至28%之量的96%乙醇溶劑。
- 1.15. 任何前述之組成物，係包括一或多種甜味劑及/或調味劑。
- 1.16. 任何前述之組成物，其中該組成物實質上為非水性，例如包括低於5%水，例如低於4%，3%，2%或1%水。

【0044】 在另外的實施例中，本發明進一步係提供乙基纖維素於製造任何組成物1及其以下的組成物之牙齒塗漆中的用途。

【實施方式】

【0045】 下列實例係進一步說明本發明之性質，但請了解，本發明不限於此。除非另有指出，否則文中及所附的申請專利範圍中所指的所有量和比例係以重量計。

實例

實例1 –在牙齒塗漆中與蟲膠/蟲膠蠟相比較，評估乙基纖維素、PVP和增加的乳香脂/松香

【0046】 在市售的非水性牙齒塗漆中評估乙基纖維素、PVP和增量的松香及乳香脂作為蟲膠和蟲膠蠟之取代物。表1係顯示市售配方的組成物、實驗配方1-4，以及本發明之組成物(配方5)。

表 1
牙齒塗漆配方之組成物

成份	市售配方	1	2	3	4	5
96%乙醇	27.16	27.16	27.16	27.16	27.16	27.16
松香	32.33	51.56	32.33	32.33	41.95	32.33
氟化鈉	5	5	5	5	5	5
乳香脂	11.95	11.95	31.18	28.68	21.57	29.18
白色蜂蠟	0.49	3	3	3	3	3
糖精	0.69	0.69	0.69	0.69	0.69	0.69
蟲膠蠟	1.3	---	---	---	---	---
蟲膠類型 101	20.44	---	---	---	---	---
乙基纖維素 (N100PH)	---	---	---	---	---	2.5
PVP(Polyclar 10)	---	---	---	2.5	---	---
風味劑	0.64	0.64	0.64	0.64	0.64	0.64
黏度(cps)	4264	1069	1231	1481	1171	11168
美妝評價	良好	差	差	差	差	良好

【0047】 蟲膠和蟲膠蠟替代調配物最初係以漸增量的蜂蠟、松香及/或乳香脂來製作。如表1所示，所生成的組成物1-4具有較低的黏度，且就調配物的安定性或均勻塗覆或塗覆時的美妝外觀上，無法提供組成物適當的稠度。組成物1-4亦顯現不可接受的相分離，使活性成份沉澱，其可能造成逐次塗覆時氟化物遞送不均勻。

【0048】 增加的蜂蠟、松香及或乳香脂無法給予懸浮氟化鈉所需的黏度，且亦造成組成物不可接受的相分離。另外添加習用的黏度調節劑聚乙烯吡咯酮(配方3)亦無法解決此問題。

【0049】 相反的，添加乙基纖維素作為蟲膠和蟲膠蠟替代物(配方5)對組成物黏度顯示意想不到的利益。所生成的組成物具有適合懸浮配方中之氟化鈉的增加黏度，且不會造成不可接受的相分離。當乙基纖維素以其成膜性質為大家所熟知的同時，其建構黏度之能力，特別是以相當低的量用於本發明組成物時，為意料之外且令人驚訝的。

實例2 – 於牙齒塗漆中與蟲膠/蟲膠蠟相比較，評估羥丙基纖維素

【0050】 同樣評估使用羥丙基纖維素(HPC)作為蟲膠/蟲膠蠟之替代物。其他的纖維素(例如羧甲基纖維素和羥甲基纖維素)被認為不適合，因為其不溶於僅以乙醇為基底的系統中，且需要水加以溶解。

【0051】 表2係顯示於調配物中使用HPC之實驗結果，該調配物包括HPC(亦即“Kucel膠”；為HPC所用的商品名)，替代蟲膠、蟲膠蠟和松香。

表 2

評估牙齒塗漆配方中之羥丙基纖維素

成份	6	7	8	9	10
96% 乙醇	27.16	27.16	27.16	27.16	27.16
增稠矽氧	2	2	2	---	1
氟化鈉	5	5	5	5	5
乳香脂	60.51	60.01	59.51	61.51	60.01
白色蜂蠟	3	3	3	3	3
糖精	0.69	0.69	0.69	0.69	0.69
蟲膠蠟	---	---	---	---	---
蟲膠類型 101	---	---	---	---	---
Kucel 膠(HPC)	1	1.5	2	2	2.5
乙基纖維素 (N100PH)	---	---	---	---	---
風味劑	0.64	0.64	0.64	0.64	0.64
黏度(cps)	2556	3165	無法測定 (結塊)	3447 (結塊)	太黏/ 白色團塊

【0052】 在濃度高達1.5%時，所生成的組成物不具有足以適當懸浮氟化鈉之黏度，而在2 - 2.5%時，則在批件中觀察到白色團塊形成，再次使此配方為不可接受的。因此，羥丙基纖維素並不具有上述之乙基纖維素之有利性質。

實例3 – 評估含乙基纖維素、無松香之牙齒塗漆調配物

【0053】 亦於含漸增濃度之乳香脂的牙齒塗漆組成物中評估使用乙基纖維素替代松香。結果係如下表3所示。

表 3

無松香之牙齒塗漆配方的組成物

成份	11	12	13
96%乙醇	27.16	27.16	27.16
松香	---	---	---
增稠矽氧	1	---	---
氟化鈉	5	5	5
乳香脂	60.01	62.01	61.01
白色蜂蠟	3	3	3
糖精	0.69	0.69	0.69
蟲膠蠟	---	---	---
蜂膠類型 101	---	---	---
乙基纖維素(N100PH)	2.5	1.5	2.5
風味劑	0.64	0.64	0.64
黏度(cps)	12502	5716	8546

【0054】 具有增加的乳香脂和乙基纖維素替代蟲膠和蟲膠蠟但無松香之組成物，雖然美妝性質不如配方5般良好，但在有(配方11)和無(配方12和13)另外的增稠矽氧下，具有適合的黏度。

【0055】 當參照實施例描述本發明的同時，熟習本項技術者應了解，在不悖離如所附的申請專利範圍所定義的本發明之範圍下，文中可作各種修改和變化。

申請專利範圍

1. 一種敏感預防性牙齒塗漆組成物，係包括
氟化物來源；
有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；
選自乳香脂、松香及其組合物之植物樹脂；及
非水性溶劑，
其中
i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及
ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。
2. 如請求項 1 之牙齒塗漆組成物，其中該植物樹脂係包括乳香脂和松香之組成物。
3. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該乙基纖維素，以組成物的重量計，係以 1%至 5%之量存在。
4. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該氟化物來源為氟化鈉，其以組成物的重量計，係以 4%至 10%之量存在。
5. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該組成物進一步係包括蜂蠟。
6. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中：
該植物樹脂係以 50%至 75%重量比之量存在；及
該蜂蠟係以 1%至 5%重量比之量存在。
7. 如請求項 5 或 6 之牙齒塗漆組成物，係包括
4%至 6%之量的氟化鈉；
2%至 3%之量的乙基纖維素；
30%至 35%之量的松香；
28%至 30%之量的乳香脂；
2%至 4%之量的蜂蠟；且
其中該非水性溶劑，以組成物的重量計，係包括 25%至 40%之量的 96%乙醇。

8. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該蜂蠟為白色蜂蠟。
9. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該乙基纖維素，具有每個無水葡萄糖單元介於 2.25 至 2.60 個乙氧基基團之平均取代值。
10. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該乙基纖維素係具有 50-200 cps 之黏度，其中該黏度係在約 25°C 使用 5%乙基纖維素溶於 80 份甲苯：20 份乙醇所組成的溶劑中之溶液所測量。
11. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，其中該 96%乙醇，以組成物的重量計，係包括 20%至 30%之量。
12. 如請求項 1 至 6 之牙齒塗漆組成物，其中該非水性溶劑為 96%乙醇。
13. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，進一步係包括一或多種甜味劑，例如糖精；調味劑，例如覆盆子調味劑；甜味劑和調味劑二者，其以組成物的重量計，各自可以至高 5%，或至高 4%，或至高 3%，或至高 2%，或至高 1%，或 0.5%至 1%之量存在牙齒塗漆組成物。
14. 如任何前述請求項之牙齒塗漆組成物，係包括低於 5%水。
15. 一種乙基纖維素於製造如任何前述請求項之牙齒塗漆中的用途。
16. 一種預防牙齒敏感或治療牙齒敏感症狀之方法，其係包括將任何前述請求項之塗漆組成物塗覆於動物之牙齒或牙齦組織。
17. 如請求項 16 之方法，其中係藉由刷子來塗覆。
18. 如請求項 16 之方法，其中係藉由噴霧來塗覆。
19. 如請求項 16 之方法，其中該動物為人類。
20. 如請求項 16 之方法，其中該動物為家畜。

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

改良的牙齒塗漆組成物及其使用方法

IMPROVED TOOTH VARNISH COMPOSITIONS AND METHODS
FOR THEIR USE

【技術領域】

本揭示文係提供包括，除其他外，乙基纖維素和氟化物之敏感預防性牙齒塗漆組成物，以及使用此等組成物供治療敏感性牙齒之方法。

【先前技術】

【0001】 氟化物組成物通常係藉由許多方法和組成物施用於牙齒，最常見的係利用含氟化物的潔牙劑組成物，例如牙膏和漱口水。

【0002】 然而，有其中希望氟化物組成物與牙齒長期接觸，以及氟化物的用量超過存在於潔牙劑組成物中氟化物的量之特定情況。

【0003】 例如，可能希望長時間以高量的氟化物治療口乾症(嘴巴乾燥)、牙齒過敏、牙齒齲蝕。

【0004】 因此，已開發出牙齒塗漆組成物，其係直接塗覆在牙齒表面，例如藉由噴霧或使用牙刷。在組成物被機械性用具，例如牙刷和咀嚼食物磨損之前，因溶劑從牙齒表面蒸發所形成的膜而得以暴露較長的時間(例如約或大於 2 小時)。

【0005】 一牙齒塗漆，及在含有天然成膜成份，例如蟲膠和蟲膠蠟之特別的牙齒塗漆中的缺點，為在某些情況下其可能具有逐批達不到完全均勻的傾向，因而影響流變性質，例如黏度，其可能造成氟化物(或其他活性成份)塗覆不均，或增加組成物塗覆於牙齒表面的困難性。

【0006】 因此，對於含有適當的合成物質供包含在牙齒塗漆中以提供良好製造、塗覆和效能性，特別是在非水性牙齒塗漆組成物中之改良的牙齒塗漆組成物有此需求。

【發明內容】

【0007】 除非另有指出，否則術語「%」或「百分比」當與本發明牙齒塗漆組成物之成份聯用時，希望係指牙齒塗漆組成物中所指成份之濕重的百分比。

【0008】 在某些實施例中，本發明係提供一非水性敏感預防性牙齒塗漆組成物，其係包括：一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；乳香脂；及一非水性溶劑；其中 i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及 ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。

【0009】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物進一步係包括松香。

【0010】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物進一步係包括蜂蠟。

【0011】 在某些實施例中，本發明之牙齒塗漆組成物係包括一氟化物來源；有效達到懸浮氟化物來源之量的乙基纖維素；選自乳香脂、松香及其組合物之植物樹脂；及一非水性溶劑；其中 i)該氟化物來源係以等於或大於乙基纖維素之量存在；及 ii)該牙齒塗漆組成物不含有蟲膠或蟲膠蠟。在此實施例之此方面的一實施例中，此塗漆進一步係包括蜂蠟。

【0012】 在某些實施例中，乙基纖維素，以組成物的重量計，係以至高5%之量存在，較佳地從1%至5%，或從1%至4%，更佳地從2%至3%，例如2.5%。

【0013】 在本發明牙齒塗漆組成物之另外的實施例中，此氟化物來源為氟化鈉，其以組成物的重量計，係以4%至10%，或5%，或6%，或7%，或8%，或9%之量存在。一般而言，氟化物來源之量係等於或大於牙齒塗漆組成物中乙基纖維素之量。